

▼アセタノールカプセル [内] <2022.3 販売中止>

【重要度】★ 【一般製剤名】アセプトロール塩酸塩 (U) acebutolol hydrochloride 【分類】高血圧・狭心症・不整脈治療剤 (β1 遮断薬)

【単位】▼100mg・▼200mg/Cap

【常用量】■高血圧症：200～400mg/日 ■狭心症・頻脈性不整脈：300～600mg/日

【用法】分2～3

【透析患者への投与方法】2/3に減量 (5)

【その他の報告】25%に減量 (12) 30～50%に減量 (3) 非腎クリアランスが代償的に上昇している可能性があり減量の必要なし (11) 100mg1 日1回, HD 日はHD 後 (17)

【PD】データがなく提示できないが, 低用量から開始して注意して観察 (17)

【CRRT】100mg を1日2回 (17)

【保存期CKD 患者への投与方法】Ccr>50mL/min : 減量の必要なし, Ccr 10～50mL/min : 2/3～常用量, Ccr<10mL/min : 2/3に減量 (5)

【その他の報告】腎障害時に未変化体の血中濃度は変化しないが, 活性代謝物の血中濃度が上昇するため減量を要する (Kirch W, et al: Clin Nephrol 18:88-94, 1982 PMID: 7140021)

Ccr>50mL/min : 減量の必要なし, Ccr 50mL/min 以下 : 75%に減量 (6)

GFR 10～50mL/min : 50%に減量, GFR<10mL/min : 30～50%に減量 (12)

GFR>50mL/min : 減量の必要なし, GFR 10～50mL/min : 50%に減量, GFR<10mL/min : 30～50%に減量 (3)

Ccr 25～50mL/min : 50%に減量, Ccr 25mL/min 未満 : 25%に減量 (U)

Ccr 25～49mL/min : 50%に減量, Ccr 25mL/min 未満 : 25%に減量 (FDA) GFR 10～50mL/min : 50%に減量, GFR 10mL/min 未満 : 25%に減量 (17)

【特徴】軽度～中等度のISAを有する比較的心選択的なβ-blockerで, 活性代謝物はβ1選択性がより高い。脂溶性は低く, 腎不全時には減量を考慮する。

【主な副作用・毒性】心不全, SLE 様症状, 間質性肺炎, 徐脈, 喘息発作, めまい, 不眠, 脱力感, 消化器症状など

【吸収】初回通過効果を受ける (U) 30～50%が初回通過効果を受ける (11)

【F】37% (6) 58.3% (Kaye CM, et al: Clin Pharmacol Ther 19: 416-20,1976) 70% (U) 高齢者で上昇 (U) 50%以上 (11) diacetolol として30～40% (11)

【tmax】1.4hr, N-アセチル体2.1hr (1) 2～3hr (11)

【代謝】一部未変化体と同じ薬理活性をもつN-アセチル体に代謝される (1) 主代謝物のdiacetololに活性があり, 未変化体よりも心選択性が高い (U) Diacetolol への変換はNATに依存しない (11)

【排泄】尿中未変化体排泄率30～40% (U,12) 3～25% (U) diacetolol として12～14%が尿中排泄 (11) 尿中排泄は糸球体ろ過と尿細管分泌による (11) 活性代謝物は腎排泄される (Smith RS, et al: Br J Clin Pharmacol 16: 253-8, 1983 PMID: 6626416)

【CL】総CL818mL/min, 腎CL298mL/min, 腎CL/総CLが36.4% (Kaye CM, et al: Clin Pharmacol Ther 19: 416-20, 1976) 腎CL13.1L/hr (Roux A, et al: Eur J Clin Pharmacol 24: 801-6, 1983 PMID: 6884417)

【t1/2】4.3hr, N-アセチル体6.7hr (1) 3～4hr (U) 3hr (6) 5～9hr (11) α相: 0.60hr β相: 3.2hr (Kaye CM, et al: Clin Pharmacol Ther 19: 416-20,1976) 3～13hr (12) 活性代謝物の半減期は長い (12) diacetolol 10～14hr (11) 腎機能にかかわらず10hrであるが, N-アセチル体は腎機能正常時12.8hrからCcr10mL/min 未満で24hrに延長 (Kirch W, et al: Clin Nephrol 18:88-94, 1982 PMID: 7140021)

【透析患者のt1/2】活性代謝物diacetololの半減期は腎不全時に延長する (6) 7hr (12)

【蛋白結合率】26% (U,6) 未変化体11～19%, diacetolol 6～9% (U)

【Vd】1.2L/kg (6,12) 3.0L/kg (Kaye CM, et al: Clin Pharmacol Ther 19: 416-20,1976) 1～2L/kg (11)

【MW】372.89

【透析性】除去されない (6) 除去される (U) 資料なし (1)

【O/W 係数】0.21 [1-オクタノール/buffer, pH7.0] (1) 【TDM のポイント】TDM の対象にならない。有効治療濃度は上室性期外収縮, 上室性頻拍: 0.5～1.0 μg/mL 以上, 心房細動: 2.0 μg/mL 以上, 心室性期外収縮: 1.8～4.6 μg/mL, 高血圧症の場合: 血中濃度との間に相関なし (1)

【更新日】20210712

※正確な情報を掲載するように努力していますが、その正確性、完全性、適切性についていかなる責任も負わず、いかなる保証もいたしません。本サイトは自己の責任で閲覧・利用することとし、それらを利用した結果、直接または間接的に生じた一切の問題について、当院でいかなる責任も負わないものとします。最新の情報については各薬剤の添付文書やインタビューフォーム等でご確認ください。

※本サイトに掲載の記事・写真などの無断転載・配信を禁じます。すべての内容は、日本国著作権法並びに国際条約により保護されています。